

**BEST AVAILABLE COPY**

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
2. Oktober 2003 (02.10.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 03/080614 A2**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07D 487/04, A01N 43/00

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/02413

(72) Erfinder; und  
(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): BOIE, Christiane [DE/DE]; Landrat-Trimborn-Str. 47, 42799 Leichlingen (DE). DUNKEL, Ralf [DE/DE]; Krischerstr. 22, 40789 Monheim (DE). ELBE, Hans-Ludwig [DE/DE]; Dasnöckel 59, 42329 Wuppertal (DE). GAYER, Herbert [AT/DE]; Sandstr. 66, 40789 Monheim (DE). GEBAUER, Olaf [DE/DE]; Jesuitengasse 111, 50737 Köln (DE). KRÜGER, Bernd-Wieland [DE/DE]; Am

(22) Internationales Anmeldedatum: 10. März 2003 (10.03.2003)

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

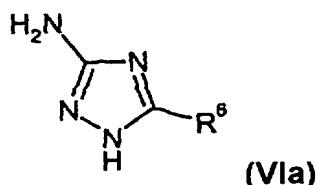
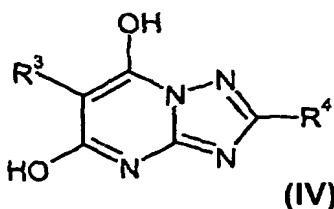
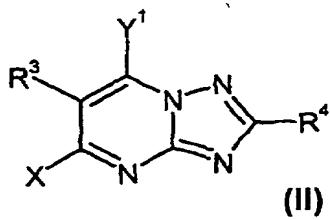
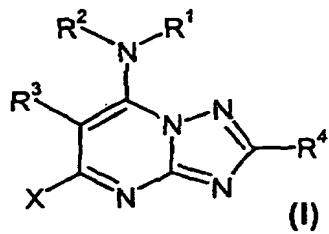
(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
102 12 886.3 22. März 2002 (22.03.2002) DE

(54) Title: TRIAZOLOPYRIMIDINES

(54) Bezeichnung: TRIAZOLOPYRIMIDINE



(57) Abstract: The invention relates to novel triazoloypyrimidines of formula (I), in which R1 represents amino, or represents optionally substituted alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, alkoxy, alkenyloxy, alkynyoxy, cycloalkyloxy, alkylamino, dialkylamino, alkenylamino, alkynylamino, cycloalkylamino, N-cycloalkyl-N-alkylamino, alkylidenamino or heterocycl, R2 represents hydrogen or optionally substituted alkyl, alkenyl, alkynyl or cycloalkyl, or R1 and R2, together with the nitrogen atom, to which they are bonded, form an optionally substituted heterocyclic ring, R3 represents an optionally mono to tetrasubstituted aryl, R4 represents halogen, cyano or optionally substituted alkoxy or dialkylamino and X represents halogen. The invention also relates to a method for producing said novel substances and

**WO 03/080614 A2**

to their use for combating undesired microorganisms. The invention further relates to novel intermediate products of formulas (II), (IV) and (VIa), in addition to methods for the production thereof.

(57) Zusammenfassung: Neue Triazoloypyrimidine der Formel (I), in welcher R1 für Amino, für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkynyoxy, Cycloalkyloxy, Alkylamino, Dialkylamino, Alkenylamino, Alkinylamino, Cycloalkylamino, N-Cycloalkyl-N-Alkylamino, Alkylidenamino oder Heterocycl steht, R2 für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl oder Cycloalkyl steht, oder R1 und R2 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring bilden, R3 für gegebenenfalls einfach bis vierfach substituiertes Aryl steht, R4 für Halogen, Cyano oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkoxy oder Dialkylamino steht und X für Halogen steht, ein Verfahren zur Herstellung dieser neuen Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen. Neue Zwischenprodukte der Formeln (II), (IV) und (VIa), sowie Verfahren zu deren Herstellung.



Vorend 52, 51467 Bergisch Gladbach (DE). HEINEMANN, Ulrich [DE/DE]; Am Sonnenhang 1, 42799 Leichlingen (DE). VOERSTE, Arnd [DE/DE]; Salierring 33, 50677 Köln (DE). GUTH, Oliver [DE/DE]; Lohrstr. 72c, 51371 Leverkusen (DE). EBBERT, Ronald [DE/DE]; Nikolaus-Kopernikus-Str. 13, 40789 Monheim (DE). WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike [DE/DE]; Oberer Markenweg 85, 56566 Neuwied (DE). MAULER-MACHNIK, Astrid [DE/DE]; Neuenkamper Weg 48, 42799 Leichlingen (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT; Law & Patents, Patents and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (*national*): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

#### Erklärungen gemäß Regel 4.17:

- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)
- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, die Priorität einer früheren Anmeldung zu beanspruchen (Regel 4.17 Ziffer iii) für alle Bestimmungsstaaten

#### Veröffentlicht:

- ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

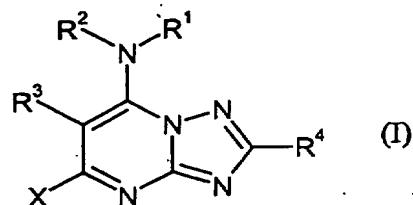
Triazolopyrimidine

Die Erfindung betrifft neue Triazolopyrimidine, ein Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

Die Erfindung betrifft außerdem neue Zwischenprodukte sowie Verfahren zu ihrer Herstellung.

Es ist bereits bekannt geworden, dass bestimmte Triazolopyrimidine fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. EP-A-0 550 113, WO 94-20501, EP-A 0 613 900, US-A 5 612 345, EP-A 0 834 513, WO 98-46607 und WO 98-46608). Die Wirkung dieser Verbindungen ist jedoch in vielen Fällen unbefriedigend.

Es wurden neue Triazolopyrimidine der Formel



in welcher

R<sup>1</sup> für Amino, für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Cycloalkyloxy, Alkylamino, Dialkylamino, Alkenylamino, Alkinylamino, Cycloalkylamino, N-Cycloalkyl-N-Alkylamino, Alkylidenamino oder Heterocyclyl steht, und

R<sup>2</sup> für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl oder Cycloalkyl steht, oder

- 2 -

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring bilden,

R<sup>3</sup> für gegebenenfalls einfach bis vierfach substituiertes Aryl steht,

5

R<sup>4</sup> für Halogen, Cyano oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkoxy oder Dialkylamino steht und

X für Halogen steht,

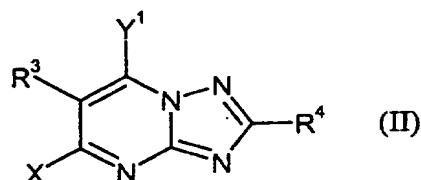
10

gefunden.

Weiterhin wurde gefunden, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) erhält, wenn man

15

a) Dihalogentriazolopyrimidine der Formel



in welcher

20

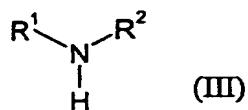
R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Y<sup>1</sup> für Halogen steht,

25

mit einem Amin der Formel

- 3 -



in welcher

$\text{R}^1$  und  $\text{R}^2$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in  
Gegenwart eines Säureakzeptors umsetzt.

Schließlich wurde gefunden, dass die neuen Triazolopyrimidine der Formel (I) eine  
10 sehr gute Wirkung gegen Schadorganismen, insbesondere eine starke fungizide  
Wirkung zeigen.

Überraschenderweise besitzen die Triazolopyrimidine der Formel (I) eine wesentlich  
bessere fungizide Wirksamkeit als die konstitutionell ähnlichen vorbekannten  
15 Stoffe gleicher Wirkungsrichtung.

Besondere Bedeutungen der Substituenten bzw. Bereiche der in den oben und nach-  
stehend aufgeführten Formeln werden im folgenden erläutert.

20  $\text{R}^1$  steht bevorzugt für Amino, für jeweils gegebenenfalls durch 1 bis 9  
Halogenatome, Hydroxy, Alkoxy, Carbalkoxy, Dialkylamino, Cyloalkyl,  
Cyano, Phenyl oder Heterocycl substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl,  
Cycloalkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Cycloalkyloxy, Alkylamino,  
Dialkylamino, Alkenylamino, Alkinylamino, Cycloalkylamino, N-Cyclo-  
25 alkyl-N-Alkylamino oder Alkylidenamino mit jeweils 1 bis 6 Kohlen-  
stoffatomen in den Alkylketten, 2 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl  
und Alkinylketten, 3 bis 7 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylresten oder 2  
bis 6 Kohlenstoffatomen im Fall von Alkylidenamino, oder für Heterocycl  
mit 5 oder 6 Ringgliedern.

- 4 -

Die genannten Phenyl- und Heterocyclreste können ihrerseits einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiert sein.

5      Als Substituenten für Heterocycl kommen vorzugsweise in Frage:

Halogen, Phenyl;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy oder Alkylthio mit jeweils  
10     1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogen-  
alkylthio mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschie-  
denen Halogenatomen;

15     Als Substituenten für Phenyl kommen vorzugsweise in Frage:

Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarb-  
amoyl;

20     jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder  
Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

25     jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6  
Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkyl-  
thio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlen-  
stoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

30

- 5 -

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 11 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

5       jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

10      jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Alkylen oder Dioxyalkylen mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen; oder

15      Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen.

R<sup>2</sup>     steht bevorzugt für Wasserstoff oder für gegebenenfalls durch Halogen oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkinyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl.

25      R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup>   stehen auch bevorzugt gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls durch Halogen, Hydroxy, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen substituierten, 3- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Ring.

30      R<sup>3</sup>     steht bevorzugt für gegebenenfalls einfach bis vierfach substituiertes Phenyl, wobei als Substituenten bevorzugt folgende in Frage kommen:

- 6 -

Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl,  
Thiocarbamoyl;

5 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkyl-  
sulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils  
10 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halo-  
genalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1  
bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogen-  
atomen;

15 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyl-  
oxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder ver-  
schiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkyl-  
20 carbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximi-  
noalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den  
einzelnen Alkylteilen;

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch  
25 Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlen-  
stoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis  
4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen  
substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Alkylen oder Dioxyalkylen mit  
jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder

30 Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen.

15      R<sup>4</sup> steht bevorzugt für Halogen, Cyano oder für jeweils gegebenenfalls durch 1 bis 13 Halogenatome substituiertes Alkoxy oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylketten.

5      X steht bevorzugt für Fluor, Chlor oder Brom.

10     R<sup>1</sup> steht besonders bevorzugt für Amino oder für Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, wobei die Alkylreste einfach bis dreifach substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Hydroxy, Methoxy, Dimethylamino, Diethylamino, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Dioxolan-2-yl, 2-Furyl, 2-Tetrahydrofuryl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Phenyl und/oder Phenoxy, oder

15     R<sup>1</sup> steht besonders bevorzugt für Alkenyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen oder Alkinyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder

20     R<sup>1</sup> steht besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Methyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl, Morpholinyl, Thiomorpholinyl, Piperazinyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Hydroxy, Methoxy, Dimethylamino, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl substituiertes Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino, 1-Methoxycarbonyl-1-methylamino, Methoxy, Ethoxy oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Benzyloxy, Pyridylmethoxy oder Thiazolylmethoxy.

25     Die genannten Pyridyl- und Thiazolylreste können auch vorzugsweise ihrerseits noch weiter substituiert sein. Als Substituenten für Pyridyl- und Thiazolyl kommen vor-

- 8 -

zugsweise infrage: Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Dichlorfluor-

5 methylthio, Trifluormethylthio, Phenyl.

Als Substituenten für Phenyl und Benzyl kommen vorzugsweise in Frage:

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl,  
10 Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethyl-  
15 sulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl,

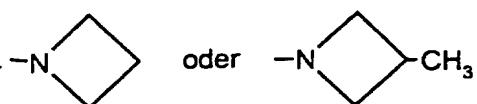
20 jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

25 Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

R<sup>2</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1-(1,1,1-Trifluor-  
30 methyl)ethyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl.

- 9 -

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> stehen auch besonders bevorzugt gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Hydroxy, Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl substituiertes Pyrrolidinyl, Piperidinyl, Morpholinyl, Thiomorpholinyl, Piperazinyl, 3,6-Dihydro-1(2H)-pyridinyl, 3,6-Dihydro-1(2H)-pyridinyl oder Tetrahydro-1(2H)-pyridazinyl, oder für die Reste der Formel



R<sup>3</sup> steht besonders bevorzugt für einfach bis vierfach substituiertes Phenyl. Als Substituenten kommen besonders bevorzugt folgende in Frage:

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Formyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Allyloxy, Propargyloxy, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trichlorethinyloxy, Trifluorethinyloxy, Chlorallyloxy, Iodpropargyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes,

- 10 -

jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

5

R<sup>4</sup> steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Trifluormethoxy, Trifluorethoxy, Dimethylamino, Ethylmethylamino oder Diethylamino.

10

X steht besonders bevorzugt für Fluor oder Chlor.

Ganz besonders bevorzugt sind diejenigen Triazolopyrimidine der Formel (I), in denen

15

R<sup>1</sup> für Amino, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, i-Butyl, s-Butyl, t-Butyl, 1,2-Dimethylpropyl, 2,2-Dimethylpropyl, n-Pentyl, 2-Methyl-butyl, 1,3-Dimethyl-butyl, 2-Methoxy-ethyl, 2-Hydroxy-ethyl, 1-Trifluormethyl-ethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1,1,1-Trifluor-2-methyl-prop-2-yl, Methoxy, Cyclopropylmethyl, 1-Cyclohexyl-ethyl, 2-Dimethylamino-ethyl, Ethoxy-carbonylmethyl, Dioxolan-2-yl-methyl, 2-Furyl-methyl, 2-Tetrahydrofuryl-methyl, Methylamino, Ethylamino, n-Propylamino, 1-Cyclopropyl-ethyl-amino, 2,2,3,3-Tetrafluoropropylamino, N-Methyl-N-methoxycarbonyl-amino, Morpholinyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Allyl, 2-Methyl-allyl oder Propargyl steht,

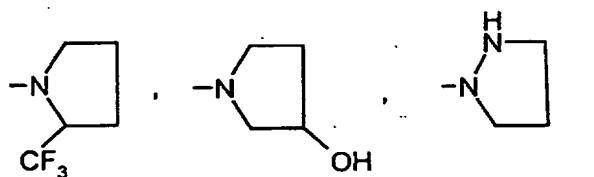
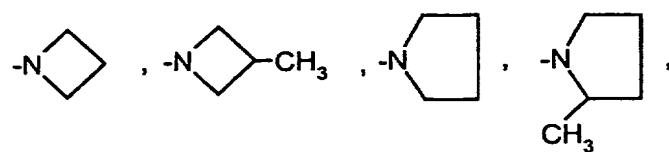
25

R<sup>2</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, i-Butyl, s-Butyl, t-Butyl, Allyl, Propargyl, 2,2,2-Trifluorethyl, Cyclopropylmethyl oder Cyclopentylmethyl steht, oder

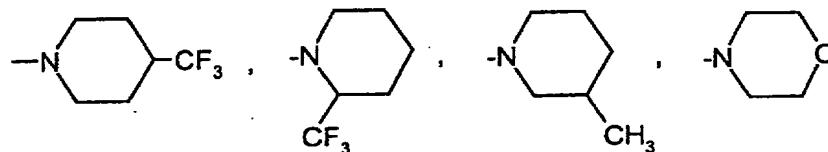
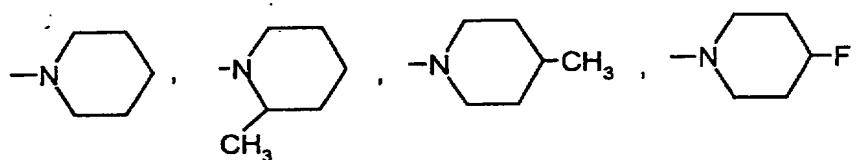
30

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen Rest der Formel

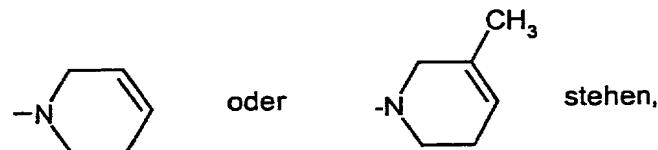
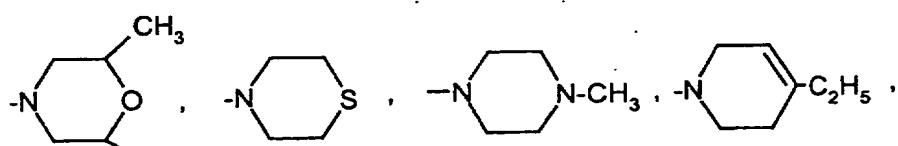
- 11 -



5



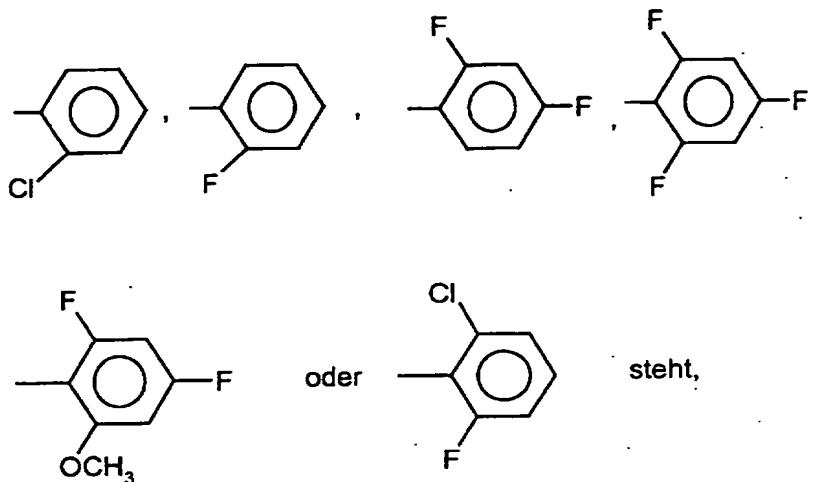
10



$\text{R}^3$  für einen Rest der Formel

15

- 12 -



5        R<sup>4</sup>      für Fluor, Chlor, Methoxy oder Dimethylamino steht und

X      für Fluor oder Chlor steht.

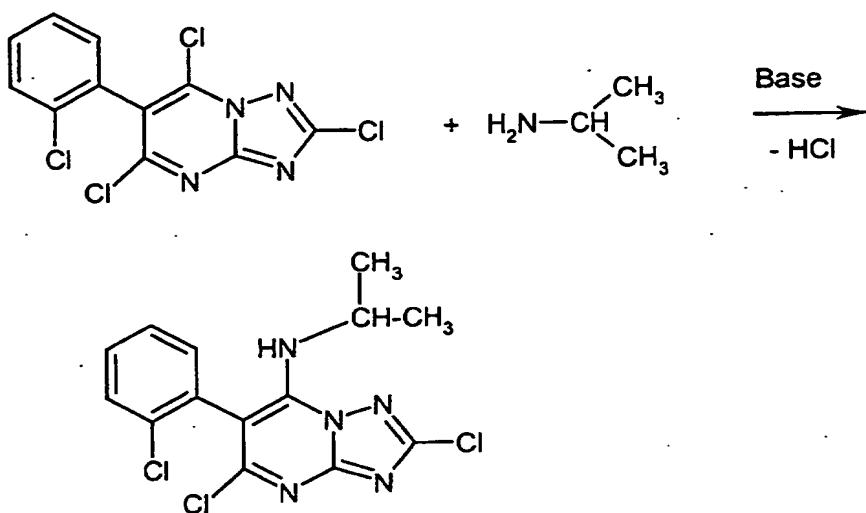
10      Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen angegebenen Reste-definitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangsstoffe bzw. Zwischenprodukte.

Die zuvor genannten Reste-Definitionen können untereinander in beliebiger Weise kombiniert werden. Außerdem können einzelne Definitionen entfallen.

15

Verwendet man 2,5,7-Trichlor-6-(2-chlorphenyl)[1,2,4]triazolo[1,5a]-pyrimidin und Isopropylamin als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

- 13 -



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Dihalogentriazolopyrimidine sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) haben R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und X vorzugsweise, bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und X angegeben wurden. Y<sup>1</sup> steht vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere für Fluor oder Chlor.

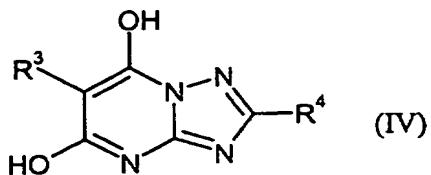
10

Die Dihalogentriazolopyrimidine der Formel (II) sind neu und ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung. Auch diese Verbindungen eignen sich zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

15 Sie werden erhalten, wenn man

(b) Dihydroxytriazolopyrimidine der Formel

- 14 -



in welcher

R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

mit einem Halogenierungsmittel, wie beispielsweise Phosphortrichlorid, Phosphortribromid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder Gemischen daraus, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie beispielsweise Chlorbenzol, umsetzt. Als Verdünnungsmittel kann auch das Halogenierungsmittel selbst, wie Phosphoroxychlorid, oder ein Halogenierungsmittelgemisch dienen.

10 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Dihydroxytriazolopyrimidine sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel haben R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> vorzugsweise, bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> angegeben wurden.

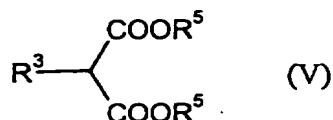
15 20 Die Dihalogentriazolopyrimidine der Formel (IV) sind neu und ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung. Auch diese Verbindungen eignen sich zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

Sie werden erhalten, wenn man

25

- 15 -

(c) Arylmalonester der Formel



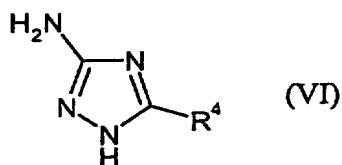
in welcher

5

$\text{R}^3$  die oben angegebene Bedeutung hat und

$\text{R}^5$  für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

10 mit einem Aminotriazol der Formel



in welcher

15  $\text{R}^4$  die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie beispielsweise eines Alkohols und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base, vorzugsweise eines tertiären Amins, wie beispielsweise Tributylamin, umgesetzt. Das als Base eingesetzte Amin  
20 kann auch gleichzeitig als Verdünnungsmittel dienen.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe benötigten Arylmalonester sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel hat  $\text{R}^3$  vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der  
25

- 16 -

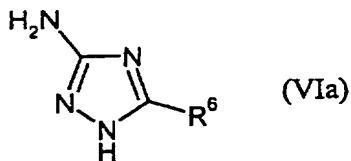
Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R<sup>3</sup> angegeben wurde.  
R<sup>5</sup> steht vorzugsweise für Methyl oder Ethyl.

Die Arylmalonester der Formel (V) sind bekannt oder können nach bekannten  
5 Methoden hergestellt werden (vgl. US 6 156 925).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe  
weiterhin benötigten Aminotriazole sind durch die Formel (VI) allgemein definiert.  
In dieser Formel hat R<sup>4</sup> vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutung, die  
10 bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindun-  
gen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R<sup>4</sup> angegeben  
wurde.

Die Aminotriazole der Formel (VI) sind bekannte Synthesechemikalien oder können  
15 nach bekannten Methoden hergestellt werden (vgl. Russian Journal of Organic  
Chemistry, Vol. 29, N. 11, 1993, Seiten 1942-1943).

Die Aminotriazole der Formel



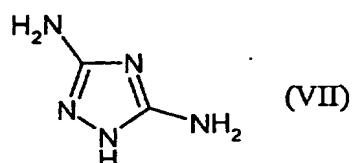
20

in welcher

R<sup>6</sup> für Cyano oder Brom steht,

25 sind neu und Gegenstand der vorliegenden Anmeldung. Auch diese Verbindungen  
eignen sich zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen.

Sie werden erhalten, indem man Diaminotriazol der Formel



- 5 zunächst diazotiert und anschließend mit einem Bromierungsmittel, wie beispielsweise Bromwasserstoff bzw. Cyanierungsmittel, wie beispielsweise Cyanwasserstoff, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart weiterer Reaktionshilfsmittel umsetzt.
- 10 Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Halogenierungsmittel sind allgemein bekannte Laborchemikalien.
- 15 Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel (III) haben R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> vorzugsweise, bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> angegeben wurden.
- 20 Die Amine der Formel (III) sind allgemein übliche Laborchemikalien oder können nach bekannten Methoden erhalten werden.
- 25 Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise

- 18 -

Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäure-triamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan.

Das erfindungsgemäße Verfahren a) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen vorzugsweise Ammoniak oder tertiäre Amine infrage, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0°C und 80°C.

Auch bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (b) und (c) können die Reaktionstemperaturen in diesen Bereich variiert werden.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro mol Dihalogentriazolopyrimidin der Formel (II) im Allgemeinen 0,5 bis 10 mol, vorzugsweise 0,8 bis 2 mol Amin der Formel (III) ein.

Die erfindungsgemäßen Verfahren werden im Allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder verminderter Druck - im Allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - zu arbeiten.

Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

5

Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

10

Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

15

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;

Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;

20

*Erwinia*-Arten, wie beispielsweise *Erwinia amylovora*;

*Pythium*-Arten, wie beispielsweise *Pythium ultimum*;

25

*Phytophthora*-Arten, wie beispielsweise *Phytophthora infestans*;

*Pseudoperonospora*-Arten, wie beispielsweise *Pseudoperonospora humuli* oder *Pseudoperonospora cubensis*;

30

*Plasmopara*-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;

- 20 -

Bremia-Arten, wie beispielsweise *Bremia lactucae*;

Peronospora-Arten, wie beispielsweise *Peronospora pisi* oder *P. brassicae*;

5 Erysiphe-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;

Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;

Podosphaera-Arten, wie beispielsweise *Podosphaera leucotricha*;

10

*Venturia*-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;

Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora teres* oder *P. graminea*  
(Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

15

*Cochliobolus*-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus*  
(Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

Uromyces-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;

20

*Puccinia*-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;

Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise *Sclerotinia sclerotiorum*;

25

*Tilletia*-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;

*Ustilago*-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda* oder *Ustilago avenae*;

Pellicularia-Arten, wie beispielsweise *Pellicularia sasakii*;

30

*Pyricularia*-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;

Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;

5 Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;

Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;

Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;

10 Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*;

Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria brassicae*;

Pseudocercosporella-Arten, wie beispielsweise *Pseudocercosporella herpotrichoides*.

15 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine sehr gute stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeneigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.

20 Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mirkroorganismen entfalten.

25 Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1

30

bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Venturia-, Podosphaera-Arten, einsetzen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzewachstums, sowie zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaren oder nicht schützbaren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und

- 23 -

Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

5 Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

10 Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

15 Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

30 Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe

- 24 -

gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

5

Alternaria, wie Alternaria tenuis,

Aspergillus, wie Aspergillus niger,

10

Chaetomium, wie Chaetomium globosum,

Coniophora, wie Coniophora puetana,

Lentinus, wie Lentinus tigrinus,

15

Penicillium, wie Penicillium glaucum,

Polyporus, wie Polyporus versicolor,

20

Aureobasidium, wie Aureobasidium pullulans,

Sclerophoma, wie Sclerophoma pityophila,

Trichoderma, wie Trichoderma viride,

25

Escherichia, wie Escherichia coli,

Pseudomonas, wie Pseudomonas aeruginosa,

30

Staphylococcus, wie Staphylococcus aureus.

- 25 -

Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie  
5 ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung  
10 von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische  
15 Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylen oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethyleketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten  
20 gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit; Montmorillonit oder Diatomenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminium-  
25 oxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstengel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage:  
30 z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester,

- 26 -

Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

5 Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

10 Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

15 Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

20 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

25 Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

**Fungizide:**

30 Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,

Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos,  
Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat,

5 Calciumpolysulfid, Carpropamid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim,  
Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol,  
Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb,  
Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram, Carpropamid

10 Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofuanid, Diclomezin, Dicloran,  
Diethofencarb, Difenoconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol,  
Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyridithione, Ditalimfos, Dithianon,  
Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,

15 Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,  
  
Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenhexamid, Fenitropan,  
Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fenthydroxyd, Ferbam,  
Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol,  
20 Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Alminium, Fosetyl-  
Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyd, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol,  
Furconazol-cis, Furmecyclox, Fluoxastrobin,

25 Guazatin,  
  
Hexachlôrobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,  
  
Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat,  
Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Iprovalicarb, Irumamycin,  
30 Isoprothiolan, Isoaledione,

- 28 -

Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfernaphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung,

5 Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomycin, Myclobutanol, Myclozolin,

Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol,

10 Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin,

Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Picoxystrobin, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, 15 Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyraclostrobin, Pyrazophos, Pyrifenoxy, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur, Prothioconazole,

Quinconazol, Quintozan (PCNB), Quinoxifen

20 Schwefel und Schwefel-Zubereitungen, Spiroxamine

Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl, Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, 25 Tridemorph, Trifloxystrobin, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,

Uniconazol,

Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,

Zarilamid, Zineb, Ziram sowie

30 Dagger G,

OK-8705,

OK-8801,  
α-(1,1-Dimethylethyl)-β-(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,  
α-(2,4-Dichlorphenyl)-β-fluor-β-propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,  
α-(2,4-Dichlorphenyl)-β-methoxy-α-methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,  
5 α-(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)-β-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,  
(5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,  
(E)-α-(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,  
1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,  
10 1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,  
1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,  
1-[(Diiodomethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,  
1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,  
1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,  
15 1-[1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,  
1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,  
2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,  
2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,  
2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,  
20 2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,  
2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,  
2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,  
2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl-β-D-glycopyranosyl)-α-D-glucopyranosyl]-amino]-4-methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,  
25 2-Aminobutan,  
2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,  
2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,  
2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyanatomethyl)-acetamid,  
2-Phenylphenol(OPP),  
30 3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,  
3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,

- 30 -

3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,  
3-[2-(4-Chlorophenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,  
4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,  
4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,  
5 8-Hydroxychinolinsulfat,  
9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,  
bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,  
cis-1-(4-Chlorophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,  
cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-  
10 hydrochlorid,  
Ethyl-[(4-chlorophenyl)-azo]-cyanoacetat,  
Kaliumhydrogencarbonat,  
Methantetrathiol-Natriumsalz,  
Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,  
15 Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,  
Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,  
N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,  
N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,  
N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,  
20 N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,  
N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,  
N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,  
N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid,  
N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,  
25 N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propynyoxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,  
N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin -Natriumsalz,  
O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,  
O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioate,  
S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat,  
30 spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,  
4-[3,4-Dimethoxyphenyl)-3-(4-fluorophenyl)-acryloyl]-morpholin

**Bakterizide:**

5 Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Octhilinon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

**Insektizide / Akarizide / Nematizide:**

10 Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,

15 Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bistrifluron, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butylpyridaben,

20 Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Chromafenozone, Cis-Resmethrin, Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidine, Cyanophos, Cyclopene, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,

25 Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlorvos, Dicofol, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn,

30 Eflusilanate, Emamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopthora spp., Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrifos,

- 32 -

5      Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim,  
Fenoxy carb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate,  
Fipronil, Fluazuron, Flubrocythrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron,  
Flumethrin, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate,  
Fubfenprox, Furathiocarb,

Granuloseviren

10     Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene,  
Imidacloprid, Indoxacarb, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin,

Kernpolyederviren

15     Lambda-cyhalothrin, Lufenuron

20     Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae,  
Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methoprene, Methomyl,  
Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin,  
Monocrotophos,

Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron

25     Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M

30     Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthroat,  
Phorat, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A,  
Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propargite, Propoxur, Prothifos, Prothoat,  
Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen,  
Pyriproxyfen,

- 33 -

Quinalphos,

Ribavirin

5

Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Sulfotep, Sulprofos,

Tau-fluvalinate, Tebufenozone, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron,  
Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon Theta-  
cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam  
hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocythrin, Tralomethrin,  
Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon,  
Triflumuron, Trimethacarb,

15

Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii

YI 5302

Zeta-cypermethrin, Zolaprofos

20

(1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-  
furanylidene)methyl]-2,2-dimethylcyclopropancarboxylat

25

(3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat  
1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-  
imin

30

2-(2-Chlor-6-fluorophenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol  
2-(Acetylxyo)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion

- 34 -

2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid

2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-difluorethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid

5

3-Methylphenyl-propylcarbamat

4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol

10 4-Chlor-2-(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-  
3(2H)-pyridazinon

4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-  
pyridazinon

15 4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorphenyl)-3(2H)-pyridazinon

Bacillus thuringiensis strain EG-2348

20 Benzoesäure [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid]

Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorphenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-  
ester

25 [3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid

Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carboxaldehyd

Ethyl-[2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbamat

30 N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin

N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-1-carboxamid

5 N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N''-nitro-guanidin

N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid

N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid

10 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat

N-Cyanomethyl-4-trifluormethyl-nicotinamid

15 3,5-Dichlor-1-(3,3-dichlor-2-propenoxy)-4-[3-(5-trifluormethylpyridin-2-yloxy)-propoxy]-benzol

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.

20 Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphasische Pilze ( z.B. gegen Candida-Spezies wie Candida albicans, Candida glabrata) sowie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Spezies wie Aspergillus niger und Aspergillus fumigatus, Trichophyton-Spezies wie Trichophyton mentagrophytes, Microsporon-Spezies wie Microsporon canis und audouinii. Die Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

25  
30

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetic Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff "Teile" bzw. "Teile von Pflanzen" oder "Pflanzenteile" wurde oben erläutert.

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten ver-

steht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften ("Traits"), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.

5 Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive ("synergistische") Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften ("Traits") verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kul-

turfpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obstpfanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften ("Traits") werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus Bacillus Thuringiensis (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden "Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften ("Traits") werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften ("Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften ("Traits") verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezichtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende

Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften ("Traits").

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den  
5 Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoff-  
mischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben  
angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen.  
Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text  
speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

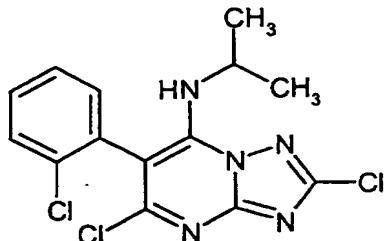
10 Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur  
Bekämpfung von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispiels-  
weise gegen Venturia-, Podosphaera-Arten, einsetzen.

15 Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe werden  
durch die folgenden Beispiele veranschaulicht.

- 40 -

### Herstellungsbeispiele

#### Beispiel 1



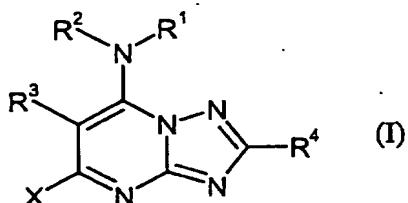
5      Verfahren a)

0,33 g (1,0 mmol) 2,5,7-Trichlor-6-(2-chlorophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin werden in 10 ml Dichlorehthan gelöst. Zu der Lösung werden 0,12 g (2,0 mmol) Isopropylamin und 0,1 g Triethylamin gegeben. Das Gemisch wird im geschlossenen Rohr 2 Stunden bei 60°C gerührt. Nach Abkühlen wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck entfernt, und der Rückstand wird säulenchromatographisch an Kieselgel (Cyclohexan/Essigester 1:1) gereinigt. Man erhält 0,11 g (18 % der Theorie, 65 % Reinheit) N-[2,5-Dichloro-6-(2-chlorophenyl)][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-yl]-N-isopropylamin.

15

HPLC: logP = 3,43

Analog Beispiel 1, sowie entsprechend den Angaben in den allgemeinen Verfahrensbeschreibungen, werden auch die in der nachstehenden Tabelle 1 genannten Verbindungen der Formel (I) erhalten.



- 41 -

Tabelle 1

Bsp.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	X	log.P*)
2	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-O-CH <sub>3</sub>	-Cl	3,26
3	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-Cl	3,52
4	i-Propylamino	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-Cl	3,33
5	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	2,99
6	-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,72
7	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,07
8	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,46
9	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,85
10	n-Propyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,37
11	Cyclopentyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,9
12	2-Methoxyethyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	2,91
13	-CH <sub>3</sub>	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	2,67
14	Cyclopropyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,1
15	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,68
16	N-Morpholinyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	2,74
17	1-Cyclopropylethylamino	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,55
18	-NH-CH <sub>2</sub> -CF <sub>2</sub> -CHF <sub>2</sub>	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,59
19	Cyclopropymethyl	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,55

- 42 -

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp.Nr.	R1	R2	R3	R4	X	log.P*)
20	1-Cyclohexylethyl	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	
21	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	2,18
22	t-Butyl	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,99
23	1-Cyclohexylethyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	4,87
24	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	2,23
25	t-Butyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,9
26	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,18
27	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,03
28	-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -		2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,81
29	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,07
30	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,59
31	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,99
32	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	4,18
33	n-Propyl	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,46
34	Cyclopentyl	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	4,03
35	2-Methoxyethyl	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	2,91
36	-CH <sub>3</sub>	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	2,7

- 43 -

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	X	log.P <sup>*</sup> )
37	Cyclopropyl	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,18
38	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,76
39	N-Morpholinyl	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	
40	Dimethylamino	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,18
41	-N(CH <sub>3</sub> )-COOCH <sub>3</sub>	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	2,55
42	Cyclohexyl	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	4,32
43	-i-Propyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,4
44	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	
45	-i-Propyl	-H	2-Chlorophenyl	-Br	-Cl	3,45
46	-CH <sub>2</sub> -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	5
47	-i-Propyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,36
48	-NH <sub>2</sub>	i-Butyl	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,67
49	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,03
50	-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,72
51	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,07
52	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,5
53	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,9
54	n-Propyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,41

- 44 -

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	X	log P <sup>*</sup> )
55	2-Methoxyethyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	2,99
56	Cyclopropyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,14
57	N-Morpholinyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	2,77
58	t-Butyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,9
59	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,14
60	Cyclopentyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,94
61	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,72
62	Cyclopropylmethyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,5
63	1-Cyclohexylethyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	4,92
64	2-Butyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,76
65	-NH <sub>2</sub>	i-Butyl	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,67
66	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,28
67	-CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,28
68	-O-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,39
69	2-Methyl-butyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	4,04
70	2-Butyl	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,79
71	-O-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,36
72	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=C(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	4,19

- 45 -

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	X	log P <sup>*</sup> )
73	2-Methyl-butyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Br	-Cl	4,05
74	2-Butyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	3,7
75	2-Methoxyethyl	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4,6-Trifluorphenyl	-Br	-Cl	3,62
76	-CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4,6-Trifluorphenyl	-Br	-Cl	4,4
77	2-Methoxyethyl	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	3,61
78	-CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	4,4
79	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=C(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -		2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl	3,18
80	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4-Difluor-6-methoxyphenyl	-O-CH <sub>3</sub>	-Cl	3,18
81	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl	4,22
82	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl	4,62
83	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CHF-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	3,55
84	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	2,71
85	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-		2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	4,33
86	-CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	3,37
87	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=C(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	4,21
88	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	4,45
89	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	4,06
90	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	4,45

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Bsp.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	X	log P*
91	-CH <sub>2</sub> -CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	4,63
92	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	4,64
93	-CH <sub>2</sub> -CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	4,87
94	-i-Propyl	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-Cl	3,42
95	-i-Propyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,31
96	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,52
97	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl	3,63
98	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	3,58
99	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Br	-Cl	3,59
100	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-Cl	3,6
101	i-Butyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,61
102	2-Butyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,63
103	Cyclopentyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,79
104	2-Methoxyethyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	2,82
105	Cyclopropyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,01
106	-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,19
107	Cyclopropylmethyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,36
108	-CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,3

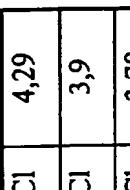
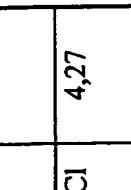
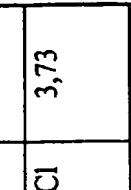
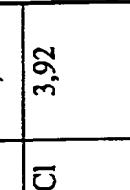
- 47 -

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	X	log.P*
109	-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4,31
110	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	1,51
111	Propargyl	-CH <sub>3</sub>	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,21
112	1,3-Dioxolan-2-ylmethyl	-CH <sub>3</sub>	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,14
113	(2-Furyl)methyl	-CH <sub>3</sub>	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,69
114	i-Butyl	-CH <sub>3</sub>	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4,08
115	2-Methoxyethyl	-CH <sub>3</sub>	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,2
116	-CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,98
117	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	1,65
118	-CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4,3
119	Allyl	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,95
120	(2-Furyl)methyl	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,98
121	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,87
122	2-Methoxyethyl	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,51
123	-CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,61
124	n-Butyl	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4,5
125	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,74
126	Cyclopropylmethyl	n-Propyl	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4,48

- 48 -

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	X	log P <sup>*</sup> )
127	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	n-Propyl	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	4,29
128	2-Methoxyethyl	n-Propyl	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,9
129			2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,78
130			2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	4,27
131			2-Chlor-6-fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,73
132	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2-Chlor-6-fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,02
133			2-Chlor-6-fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,92
134	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2-Chlor-6-fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,54
135	2-Methoxyethyl	n-Propyl	2-Chlor-6-fluorophenyl	-Cl	-Cl	4,06
136	-CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Chlor-6-fluorophenyl	-Cl	-Cl	4,51
137	Allyl	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Chlor-6-fluorophenyl	-Cl	-Cl	4,16
138	2-Methoxyethyl	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Chlor-6-fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,66
139	i-Butyl	-H	2-Chlor-6-fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,74
140	2-Butyl	-H	2-Chlor-6-fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,75

- 49 -

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	X	log.P <sup>*</sup> )
141	-CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-Cl	4,18
142	Cyclopentyl	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-Cl	3,9
143	Cyclopropylmethyl	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-Cl	3,49
144	-CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-Cl	3,4
145	-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-Cl	4,43
146	Allyl	-CH <sub>3</sub>	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-Cl	3,84
147	i-Butyl	-CH <sub>3</sub>	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-Cl	4,29
148	2-Methoxyethyl	-CH <sub>3</sub>	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-Cl	3,32
149	-CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-Cl	4,18
150	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-Cl	4,19
151	-CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-Cl	3,34
152	-NH-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4,6-Trifluorophenyl	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-Cl	
153	-CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4,05
154	-CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,33
155	Allyl	-CH <sub>3</sub>	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,7
156	-CH <sub>2</sub> -CH(OH)-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	2,33
157	-CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4,09
158	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,43

- 50 -

Tabelle 1 (Fortsetzung)

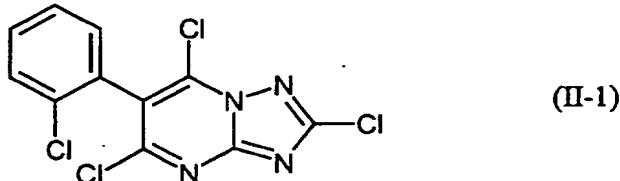
Bsp.Nr.	R1	R2	R3	R4	X	log P*)
159	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub> -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,76
160			2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4,39
161	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4,4
162	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=C(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4,13
163	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CHF-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,5
164	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4,07
165	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4
166	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	2,92
167	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,6
168	-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-Cl	3,25
169	1,2-Dimethyl-propyl	H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Br	-Cl	4,02
170	1,2-Dimethyl-propyl	H	2-Chlorphenyl	-Br	-Cl	4,18
171	1,2-Dimethyl-propyl	H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	4,01
172	1,2-Dimethyl-propyl	H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-Cl	4,09
173	1,2-Dimethyl-propyl	H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,96
174	1,2-Dimethyl-propyl	H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	4,01
175	1,2-Dimethyl-propyl	H	2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl	4,16

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	X	log P*)
176	-CH-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Br	-Cl	4,38

\*) Die Bestimmung der logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V. A8 durch HPLC  
(Gradientenmethode, Acetonitri/0,1 % wässrige Phosphorsäure)

- 52 -

Herstellung der Vorprodukte der Formel (II)Beispiel 177

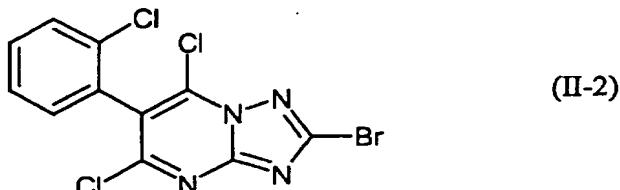
## 5 Verfahren b)

14,2 g rohes 2-Chlor-6-(2-chlorphenyl)-7-hydroxy[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-5(4H)-on wird mit 63 g (0.41 mol) Phosphoroxychlorid versetzt. 5,5 g (26,4 mmol) Phosphorpentachlorid werden portionsweise dazu gegeben. Die Mischung wird 10 16 Stunden unter Rückfluss erhitzt. Nach dem Abkühlen wird mit Wasser versetzt und 3 mal mit jeweils 100 ml Dichlormethan extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden über Natriumsulfat getrocknet und dann unter verminderter Druck eingeengt. Der verbleibende Rückstand wird säulenchromatographisch an Kieselgel 15 mit Cyclohexan/Essigester (9:1) gereinigt. Man erhält 2,6 g (17 % der Theorie über 2 Stufen) 2,5,7-Trichlor-6-(2-chlorphenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin.

HPLC: logP = 3,37

Nach der zuvor angegebenen Methode werden auch die in den folgenden Beispielen aufgeführten Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel (II) erhalten.

20

Beispiel 178

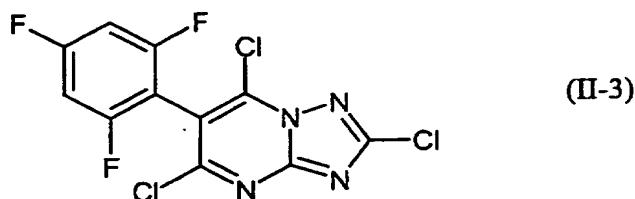
- 53 -

2-Brom-5,7-dichlor-6-(2-chlorphenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin

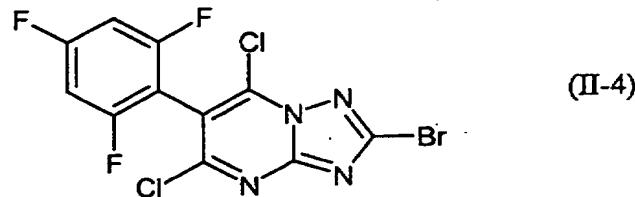
HPLC: logP = 3,39

Beispiel 179

5



10

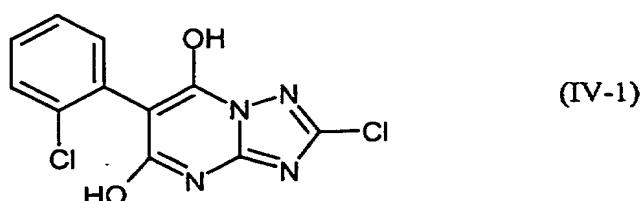
Beispiel 180

15

Herstellung der Vorprodukte der Formel (IV)Beispiel 181

20

Verfahren c)

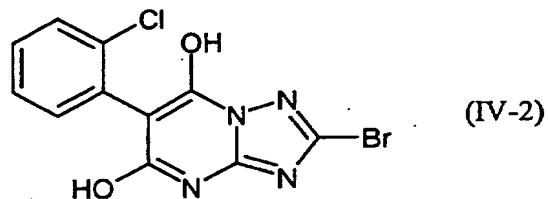


- 54 -

5 5,5 g (46,3 mmol) 5-Chlor-4H-1,2,4-triazol-3-ylamin, 11,2 g (46,3 mmol) Dimethyl-  
2-(2-chlorphenyl)malonat und 9,4 g (50,9 mmol) Tributylamin werden 16 Stunden  
bei 180°C gerührt. Das während der Reaktion entstehende Methanol wird  
kontinuierlich abdestilliert. Das Reaktionsgemisch wird im Hochvakuum eingeengt.  
Man erhält 14,2 g rohes 2-Chlor-6-(2-chlorphenyl)-7-hydroxy[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-5(4H)-on, das ohne weitere Reinigung im nächsten Reaktionsschritt ein-  
gesetzt wird.

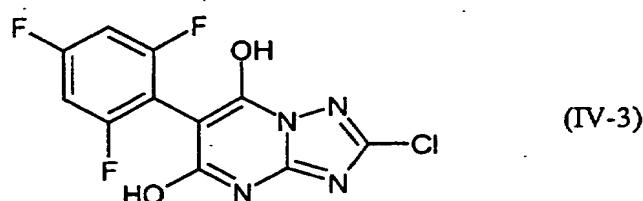
10 Analog wurden erhalten:

Beispiel 182



15 2-Brom-6-(2-chlorphenyl)-7-hydroxy[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-5(4H)-on

Beispiel 183

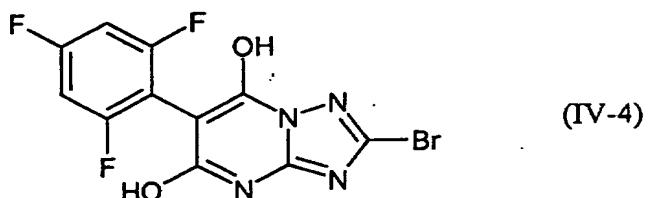


20

2-Brom-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-7-hydroxy[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-5(4H)-on

- 55 -

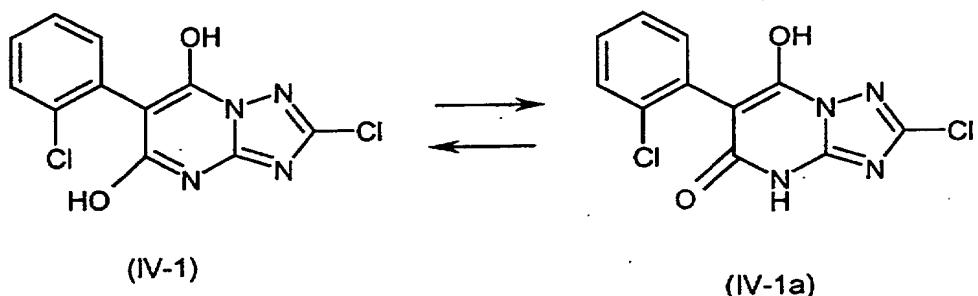
### Beispiel 184



5 2-Chlor-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-7-hydroxy[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-5(4H)-on

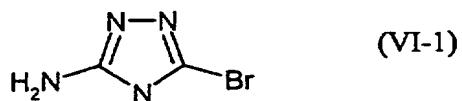
Die in den Beispielen 181-184 aufgeführten Verbindungen können sowohl in der Dihydroxy-Form als auch in der tautomeren Keto-Form auftreten. Für die Verbindung (IV-1) lässt sich dieses formelmäßig wie folgt veranschaulichen.

10



#### **Herstellung der Vorprodukte der Formel (VI)**

### 15 Beispiel 185



9,7 g (0,098 mol) Guanazol (1,2,4-Triazol-3,5-diamin) werden mit 180 ml (3,3 mol) Bromwasserstoffsäure versetzt und auf 0 bis 5°C abgekühlt. Unter Rühren wird bei dieser Temperatur eine Lösung aus 8,45 g (0,12 mol) Natriumnitrit in 20 ml Wasser

- 56 -

langsam zugetropft. Die Reaktionsmischung wird langsam auf Raumtemperatur erwärmt und anschließend für 16 h unter Rückfluß erhitzt. Zur Aufarbeitung wird die Reaktionslösung abgekühlt, auf etwa 1 l Eis gegeben und mit halbkonzentrierter Natronlauge basisch gestellt. Die wässrige Lösung wird unter verminderter Druck 5 auf etwa 500 ml eingeengt und im flüssig-flüssig-Extraktor für mehrere Tage mit Essigester extrahiert. Nach Entfernen des organischen Lösungsmittels fallen 12,2 g 5-Brom-1,2,4-triazol-3-amin in 80 %iger Reinheit an (Ausbeute: 61 %).

HPLG: log P = 0,37

VerwendungsbeispieleBeispiel: A

5 Podosphaera-Test (Apfel) / protektiv

Lösungsmittel: 24,5 Gewichtsteile Aceton

24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

Emulgator: 1,0 Gewichtsteile Alkyl-Aryl-Polyglykolether

10

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension des Apfelmehltauerregers *Podosphaera leucotricha* inkuliert. Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 23°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 70 % aufgestellt.

20

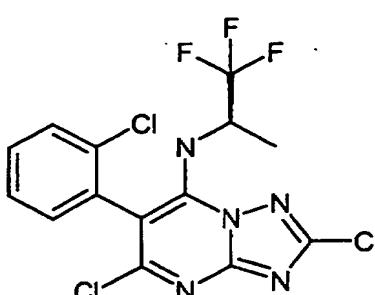
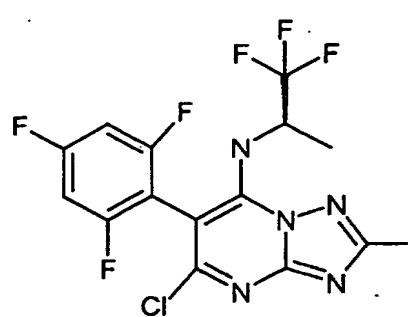
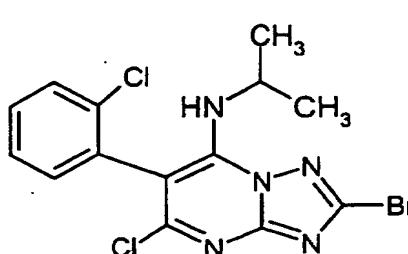
10 Tage nach der Inkulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

25

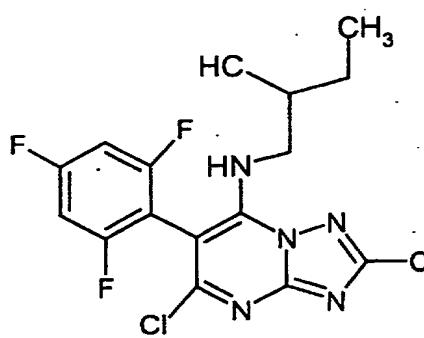
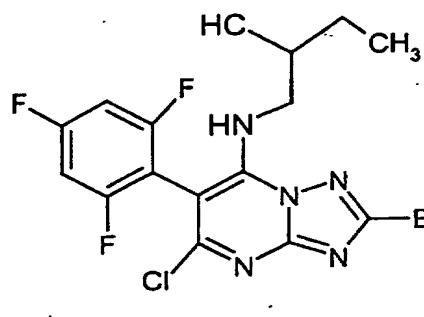
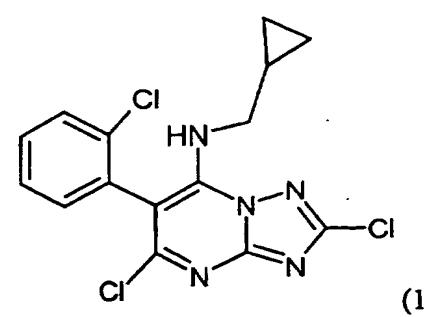
Wirkstoffe, Aufwandmengen an Wirkstoff und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle A

Podosphaera-Test (Apfel) / protektiv

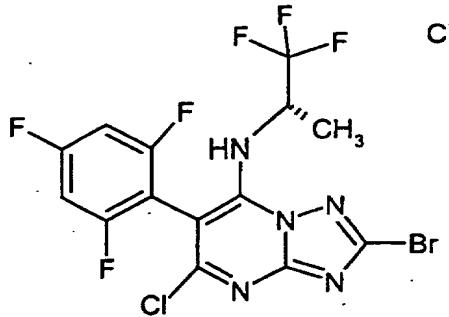
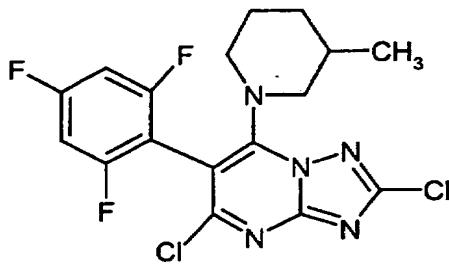
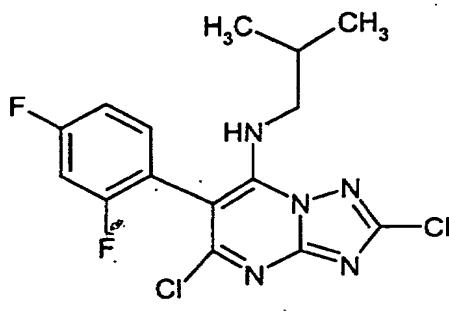
Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
<b>Erfindungsgemäß:</b>		
	100	100
(97)		
	100	100
(98)		
	100	87
(45)		

**Tabelle A (Fortsetzung)**

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
<b>Erfindungsgemäß:</b>		
	100	100
<b>(69)</b>		
	100	94
<b>(73)</b>		
	100	97
<b>(19)</b>		

- 60 -

**Tabelle A (Fortsetzung)**

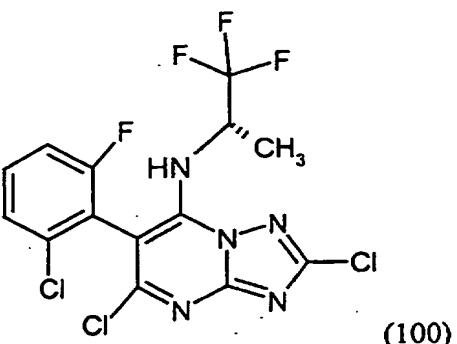
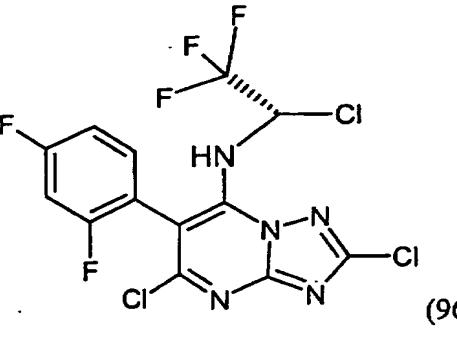
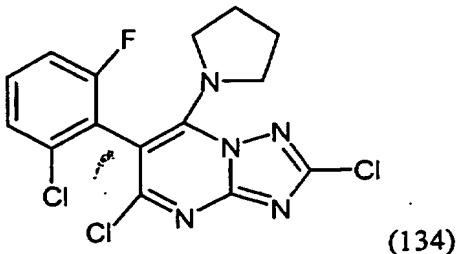
Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
<b>Erfindungsgemäß</b>		
 <p style="text-align: center;">Chiral</p> <p style="text-align: center;">(99)</p>	100	100
 <p style="text-align: center;">(88)</p>	199	94
 <p style="text-align: center;">(101)</p>	100	100

- 61 -

Tabelle A (Fortsetzung)

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
-----------	--------------------------------------	----------------------

Erfindungsgemäß:

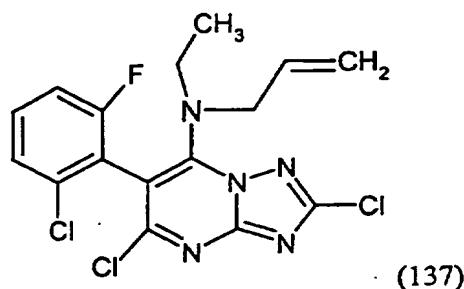
	100	100
	100	100
	100	93

- 62 -

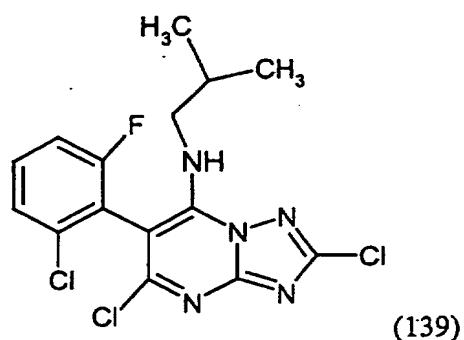
**Tabelle A (Fortsetzung)**

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
-----------	--------------------------------------	----------------------

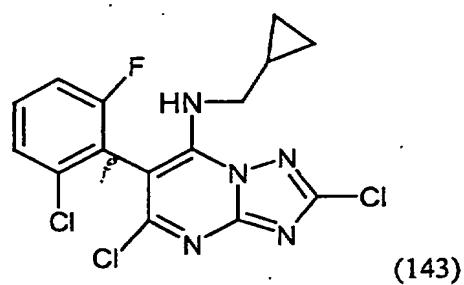
Erfindungsgemäß:



100 95



100 100



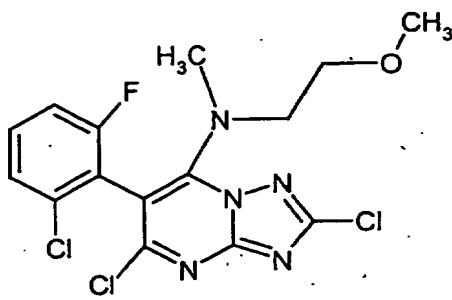
100 100

- 63 -

**Tabelle A (Fortsetzung)**

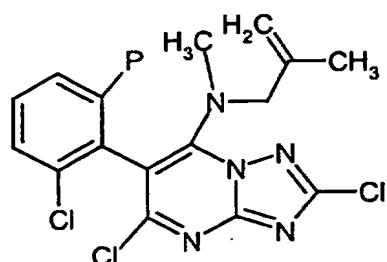
Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
-----------	--------------------------------------	----------------------

Erfolgsgemäß:



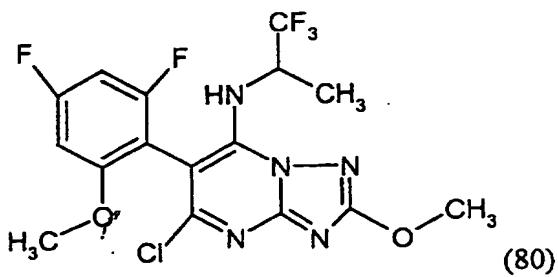
(148)

100 100



(149)

100 100



100 83

Beispiel B

Venturia - Test (Apfel) / protektiv

5      Lösungsmittel:        24,5 Gewichtsteile Aceton  
                                24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid  
Emulgator:        1,0 Gewichtsteile Alkyl-Aryl-Polyglykolether

10     Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man  
1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emul-  
gator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15     Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoff-  
zubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des  
Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Konidiensuspension des  
Apfelschorferregers Venturia inaequalis inkokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca.  
20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubations-kabine.

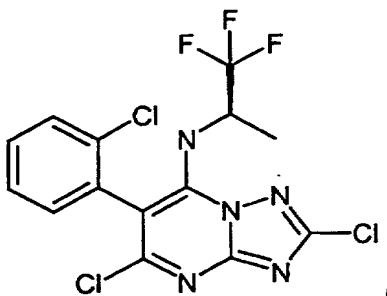
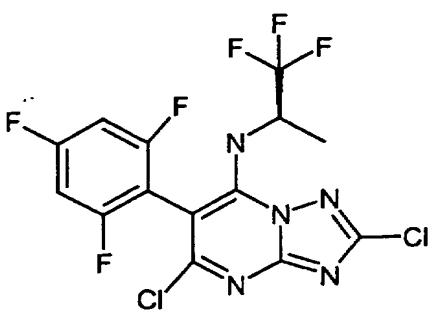
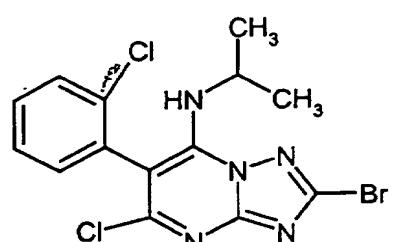
20     Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luft-  
feuchtigkeit von ca. 90 % aufgestellt.

10 Tage nach der Inkokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein  
Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad  
von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

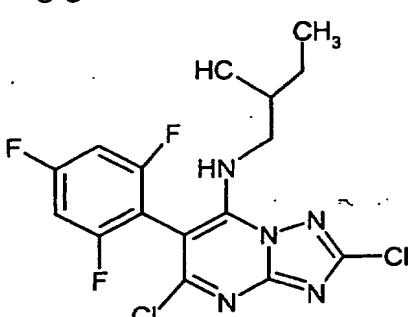
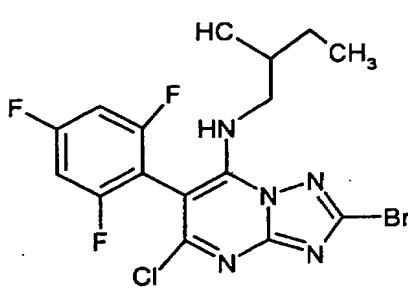
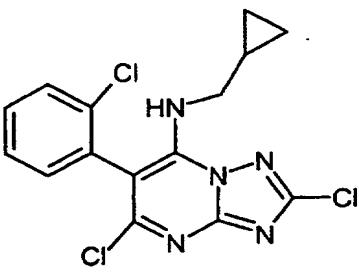
25     Wirkstoffe, Aufwandmengen an Wirkstoff und Versuchsergebnisse gehen aus der  
folgenden Tabelle hervor.

Tabelle B

Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
<b>Erfnungsgemäß:</b>		
	100	100
(97)		
	100	100
(98)		
	100	98
(45)		

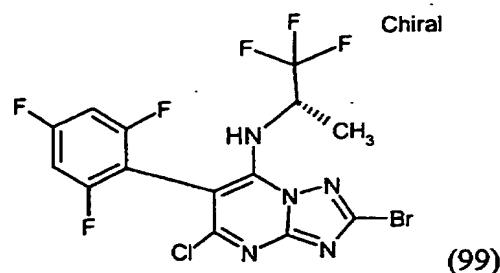
**Tabelle B (Fortsetzung)**

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
<b>Erfindungsgemäß:</b>		
	100	83
(69)		
	100	80
(73)		
	100	96
(19)		

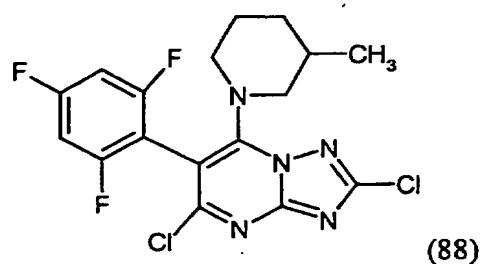
- 67 -

**Tabelle B** (Fortsetzung)

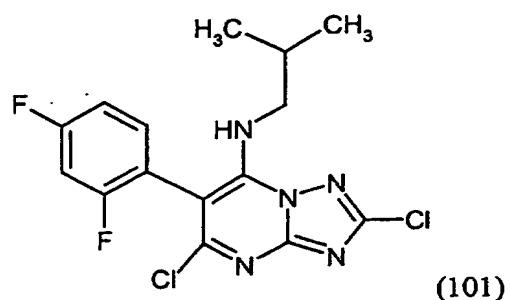
Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
-----------	---	----------------------

**Erfindungsgemäß:**

100      99

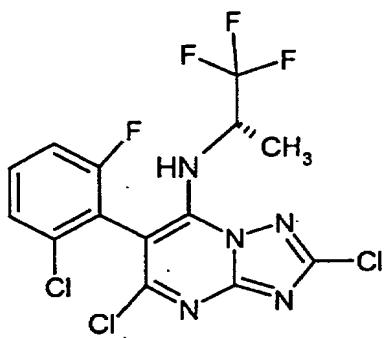
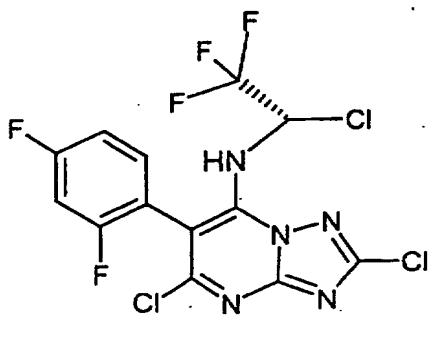
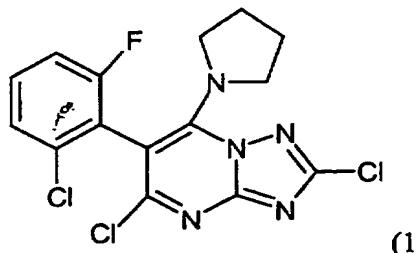


100      96



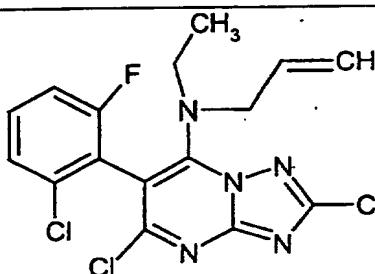
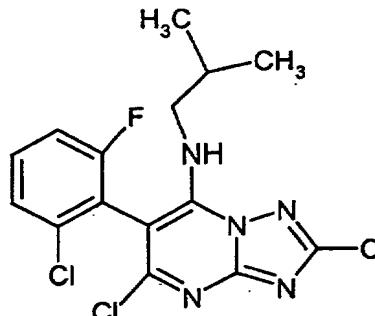
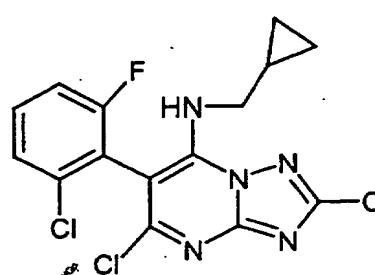
100      85

**Tabelle B (Fortsetzung)**

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
<b>Erfolgsgemäß:</b>		
	100	100
	100	100
	100	85

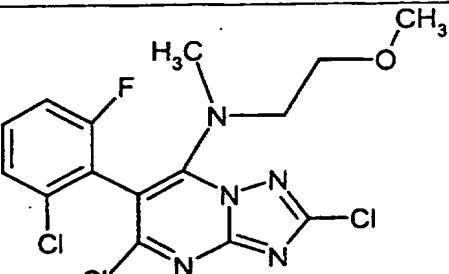
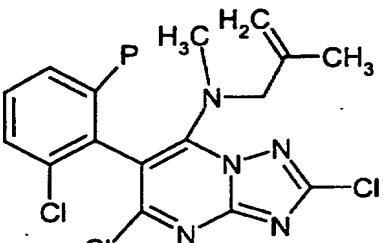
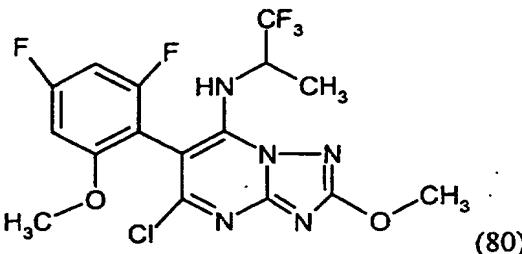
- 69 -

**Tabelle B** (Fortsetzung)

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
 (137)	100	96
 (139)	100	91
 (143)	100	99

- 70 -

Tabelle B (Fortsetzung)

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
 (148)	100	96
 (149)	100	84
 (80)	100	99

Beispiel C

## Pyricularia-Test (Reis) / protektiv

5      Lösungsmittel:      25 Gewichtsteile N,N-Dimethylacetamid  
Emulgator:      0,6 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

10     Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und verdünnt das Konzentrat mit Wasser und der angegebenen Menge Emulgator auf die gewünschte Konzentration.

15     Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Reispflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. Nach dem Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von Pyricularia oryzae inkuliert. Anschließend werden die Pflanzen in einem Gewächshaus bei 100 % relativer Luftfeuchtigkeit und 25°C aufgestellt.

20     6 Tage nach der Inkulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

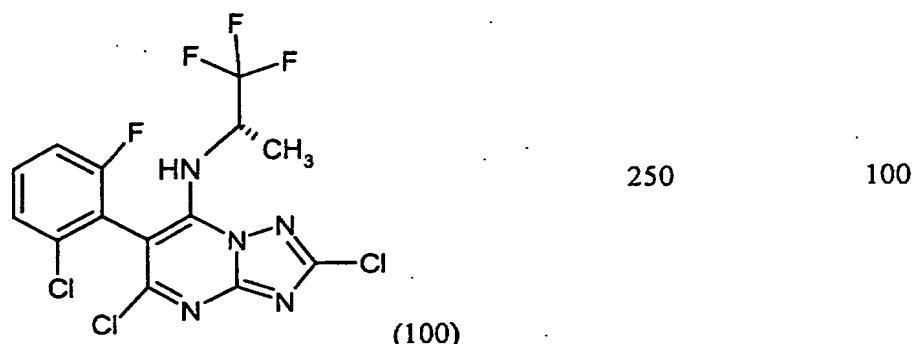
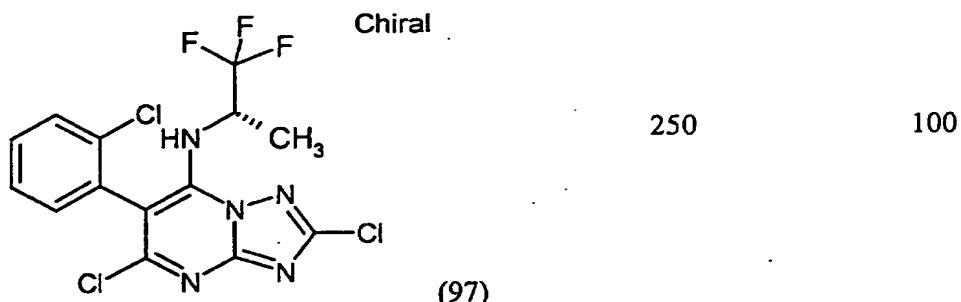
Wirkstoffe, Aufwandmengen an Wirkstoff und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

- 72 -

**Tabelle C**  
Pyricularia-Test (Reis) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
-----------	--------------------------------------	----------------------

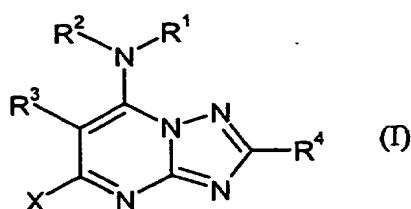
Erfindungsgemäß:



- 73 -

Patentansprüche

1. Triazolopyrimidine der Formel



5

in welcher

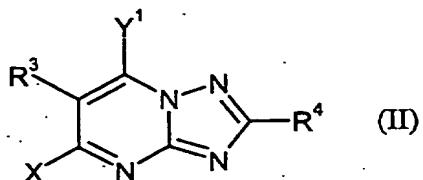
- 10       $\text{R}^1$  für Amino, für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Cycloalkyloxy, Alkylamino, Dialkylamino, Alkenylamino, Alkinylamino, Cycloalkylamino, N-Cycloalkyl-N-Alkylamino, Alkylideneamino oder Heterocyclyl steht, und
- 15       $\text{R}^2$  für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl oder Cycloalkyl steht, oder  
 $\text{R}^1$  und  $\text{R}^2$  gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring bilden,
- 20       $\text{R}^3$  für gegebenenfalls einfach bis vierfach substituiertes Aryl steht,
- 25       $\text{R}^4$  für Halogen, Cyano oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkoxy oder Dialkylamino steht und
- $\text{X}$  für Halogen steht.

- 74 -

2. Verfahren zur Herstellung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man

(a) Dihalogentriazolopyrimidine der Formel

5



in welcher

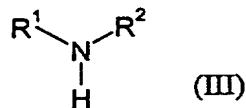
10

$\text{R}^3$ ,  $\text{R}^4$  und  $\text{X}$  die oben angegebenen Bedeutungen haben und

$\text{Y}^1$  für Halogen steht,

15

mit einem Amin der Formel



in welcher

$\text{R}^1$  und  $\text{R}^2$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, umgesetzt.

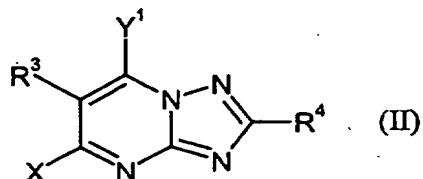
25

3. Mittel zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Triazolopyrimidin der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

- 75 -

4. Verwendung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.
  
5. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die unerwünschten Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum aus bringt.
  
6. Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.
  
7. Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel

15



in welcher

20

R³, R⁴ und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

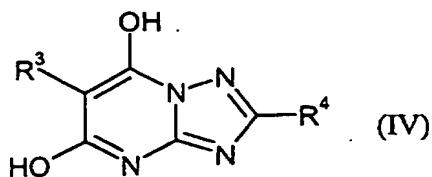
Y¹ für Halogen steht.

25

8. Verfahren zur Herstellung von Dihalogen-triazolopyrimidinen der Formel (II) gemäß Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, dass man

- 76 -

(b) Dihydroxytriazolopyrimidine der Formel



in welcher

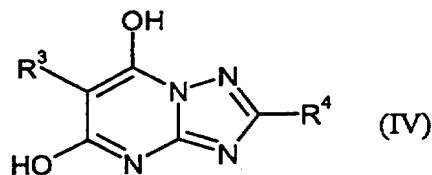
5

$\text{R}^3$  und  $\text{R}^4$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Halogenierungsmitteln, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

9. Dihydroxy-triazolopyrimidine der Formel

10



in welcher

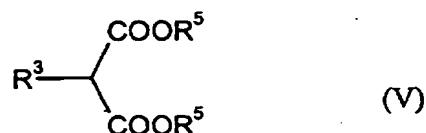
$\text{R}^3$  und  $\text{R}^4$  die oben angegebenen Bedeutungen haben.

15

10. Verfahren zur Herstellung von Dihydroxy-triazolopyrimidinen der Formel (IV) gemäß Anspruch 9, dadurch gekennzeichnet, dass man

- 77 -

## (c) Arylmalonester der Formel



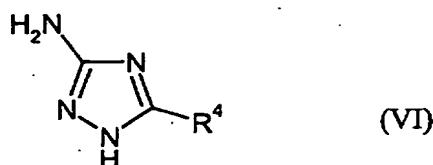
in welcher

5

 $\text{R}^3$  die oben angegebenen Bedeutungen hat und $\text{R}^5$  für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

10

## mit Aminotriazolen der Formel



in welcher

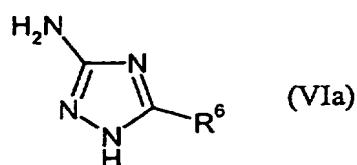
15

 $\text{R}^4$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

20

## 11. Aminotriazole der Formel

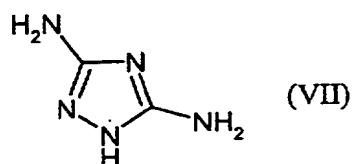


in welcher

- 78 -

R<sup>6</sup> für Cyan oder Brom steht.

12. Verfahren zur Herstellung von Aminotriazolen der Formel (VI) gemäß  
5 Anspruch 11, dadurch gekennzeichnet, dass man Diaminotriazol der Formel



10 zunächst diazotiert und anschließend mit einem Bromierungsmittel, bzw. mit Cyanierungsmitteln, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart weiterer Reaktionshilfsmittel umsetzt.

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
2. Oktober 2003 (02.10.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2003/080614 A3**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07D 487/04,  
A01N 43/00

(71) Anmelder (*für alle Bestimmungstaaten mit Ausnahme von US*): BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/002413

(72) Erfinder; und  
(75) Erfinder/Anmelder (*nur für US*): BOIE, Christiane [DE/DE]; Landrat-Trimborn-Str. 47, 42799 Leichlingen (DE). DUNKEL, Ralf [DE/DE]; Krischerstr. 22, 40789 Monheim (DE). ELBE, Hans-Ludwig [DE/DE]; Dasnöckel 59, 42329 Wuppertal (DE). GAYER, Herbert [AT/DE]; Sandstr. 66, 40789 Monheim (DE). GEBAUER, Olaf [DE/DE]; Jesuitengasse 111, 50737 Köln (DE). KRÜGER, Bernd-Wieland [DE/DE]; Am Vorend 52, 51467 Bergisch Gladbach (DE). HEINEMANN, Ulrich [DE/DE]; Am Sonnenhang 1, 42799

(22) Internationales Anmeldedatum:  
10. März 2003 (10.03.2003)

Deutsch

(25) Einreichungssprache:

Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache:

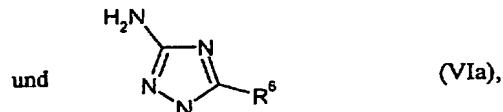
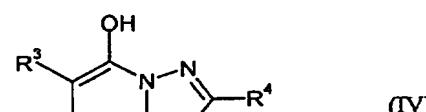
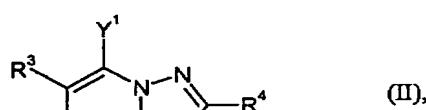
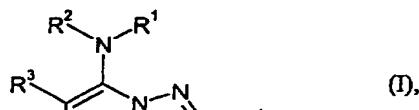
Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
102 12 886.3 22. März 2002 (22.03.2002) DE

*[Fortsetzung auf der nächsten Seite]*

(54) Title: TRIAZOLOPYRIMIDINES USED AS FUNGICIDES

(54) Bezeichnung: TRIAZOLOPYRIMIDINE ALS FUNGIZIDE



(57) Abstract: The invention relates to novel triazolopyrimidines of formula (I), in which R1 represents amino, or represents optionally substituted alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, alkoxy, alkenyloxy, alkynyoxy, cycloalkyloxy, alkylamino, dialkylamino, alkenylamino, alkynylamino, cycloalkylamino, N-cycloalkyl-N-alkylamino, alkylidenamino or heterocycl, R2 represents hydrogen or optionally substituted alkyl, alkenyl, alkynyl or cycloalkyl, or R1 and R2, together with the nitrogen atom, to which they are bonded, form an optionally substituted heterocyclic ring, R3 represents an optionally mono to tetrasubstituted aryl, R4 represents halogen, cyano or optionally substituted alkoxy or dialkylamino and X represents halogen. The invention also relates to a method for producing said novel substances and to their use for combating undesired microorganisms. The invention further relates to novel intermediate products of formulas (II), (IV) and (VIa), in addition to methods for the production thereof.

(57) Zusammenfassung: Neue Triazolopyrimidine der Formel (I), in welcher R1 für Amino, für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkynyoxy, Cycloalkyloxy, Alkylamino, Dialkylamino, Alkenylamino, Alkynylamino, Cycloalkylamino, N-Cycloalkyl-N-Alkylamino, Alkylidenamino oder Heterocycl steht, R2 für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl oder Cycloalkyl steht, oder R1 und R2 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring bilden, R3 für gegebenenfalls einfach bis vierfach substituiertes Aryl steht, R4 für Halogen, Cyano oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkoxy oder Dialkylamino steht und X für Halogen steht, ein Verfahren zur Herstellung dieser neuen Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen. Neue Zwischenprodukte der Formeln (II), (IV) und (VIa), sowie Verfahren zu deren Herstellung.

WO 2003/080614 A3



Leichlingen (DE). **VOERSTE**, Arnd [DE/DE]; Salier-ring 33, 50677 Köln (DE). **GUTH**, Oliver [DE/DE]; Lohrstr. 72c, 51371 Leverkusen (DE). **EBBERT**, Ronald [DE/DE]; Nikolaus-Kopernikus-Str. 13, 40789 Mon-heim (DE). **WACHENDORFF-NEUMANN**, Ulrike [DE/DE]; Oberer Markenweg 85, 56566 Neuwied (DE). **MAULER-MACHNIK**, Astrid [DE/DE]; Neuenkamper Weg 48, 42799 Leichlingen (DE).

(74) **Gemeinsamer Vertreter:** **BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT**; Law & Patents, Patents and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

(81) **Bestimmungsstaaten (national):** AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

(84) **Bestimmungsstaaten (regional):** ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

#### Erklärungen gemäß Regel 4.17:

- *hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)*
- *hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, die Priorität einer früheren Anmeldung zu beanspruchen (Regel 4.17 Ziffer iii) für alle Bestimmungsstaaten*

#### Veröffentlicht:

- *mit internationalem Recherchenbericht*

(88) **Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts:** 8. Januar 2004

*Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.*

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP 03/02413

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**  
**IPC 7 C07D487/04 A01N43/00**

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)  
**IPC 7 C07D A01N**

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 02 02536 A (BAYER AGROCHEM KK ;GOTO TOSHIRO (JP); UENO CHIEKO (JP); NARABU SHIN) 10 January 2002 (2002-01-10) example 274	1-3
Y	EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID CO) 8 April 1998 (1998-04-08) cited in the application claim 1	1-12
Y	WO 98 46607 A (AMERICAN CYANAMID CO) 22 October 1998 (1998-10-22) cited in the application claim 1	1-12
	-/-	
	:	
	:	
	:	

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

\* Special categories of cited documents :

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- "Z" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

7 July 2003

Date of mailing of the international search report

02.10.03

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5618 Patentaan 2  
NL-2280 HV Rijswijk  
Tel: (+31-70) 340-2040, Tx: 31 651 epo nl.  
Fax: (+31-70) 340-3018

Authorized officer

Grassi, D.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 03/02413

## C(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 98 46608 A (AMERICAN CYANAMID CO) 22 October 1998 (1998-10-22) cited in the application claim 1 -----	1-12
Y	EP 0 550 113 A (SHELL INT RESEARCH) 7 July 1993 (1993-07-07) cited in the application claim 1 -----	1-12
P,X	WO 02 088126 A (KRUEGER BERND WIELAND ;MAULER-MACHNIK ASTRID (DE); DUNKEL RALF (DE) 7 November 2002 (2002-11-07) the whole document -----	1-12
P,X	WO 02 088127 A (KRUEGER BERND-WIELAND ;DUNKEL RALF (DE); EBBERT RONALD (DE); BAYER) 7 November 2002 (2002-11-07) the whole document -----	1-12
X	KOFMAN ET AL.: RUSS. J. ORG. CHEM., vol. 29, no. 11, 1993, pages 1942-1943, XP009012611 cited in the application the whole document -----	10,11

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

PCT/EP03/02413

**Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)**

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1.  Claims Nos.: because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
  
2.  Claims Nos.: because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
  
3.  Claims Nos.: because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

**Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)**

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

**SEE SUPPLEMENTAL SHEET**

1.  As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2.  As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3.  As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
  
4.  No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

1-10

**Remark on Protest**

The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.  
 No protest accompanied the payment of additional search fees.

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

**PCT/EP03/02413**

The International Searching Authority has determined that this international application contains multiple (groups of) inventions, namely:

**1. Claims: 1-10**

Compounds as per Claim 1, precursors thereof, the production and use thereof.

**2. Claims: 11 (in part), 12 (in part)**

Aminotriazoles and the production thereof (R6 is cyanogen).

**3. Claims 11 (in part), 12 (in part)**

Aminotriazoles and the production thereof (R6 is bromine).

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 03/02413

Patent document cited in search report	Publication date		Patent family member(s)	Publication date
WO 0202536	A 10-01-2002	JP	2002080460 A AU 7440101 A BR 0112243 A CA 2414879 A1 CN 1440394 T EP 1301492 A1 WO 0202536 A1	19-03-2002 14-01-2002 24-06-2003 10-01-2002 03-09-2003 16-04-2003 10-01-2002
EP 0834513	A 08-04-1998	US	5817663 A AT 221069 T DE 69714171 D1 DE 69714171 T2 EP 0834513 A2 JP 10152489 A US 5965561 A	06-10-1998 15-08-2002 29-08-2002 12-12-2002 08-04-1998 09-06-1998 12-10-1999
WO 9846607	A 22-10-1998	AT	202779 T AU 6576898 A DE 69801048 D1 DE 69801048 T2 DK 975634 T3 EP 0975634 A1 ES 2160408 T3 GR 3036714 T3 PT 975634 T WO 9846607 A1 ZA 9803055 A	15-07-2001 11-11-1998 09-08-2001 14-03-2002 24-09-2001 02-02-2000 01-11-2001 31-12-2001 28-12-2001 22-10-1998 11-10-1999
WO 9846608	A 22-10-1998	AT	239727 T AU 735730 B2 AU 6867198 A BG 103805 A BR 9808531 A CN 1104433 B DE 69814375 D1 DK 975635 T3 EA 2906 B1 EE 9900486 A EP 0975635 A1 HU 0001993 A2 JP 2001520650 T NO 994973 A NZ 500143 A PL 336164 A1 SK 141499 A3 TR 9902552 T2 TW 460476 B WO 9846608 A1 ZA 9803054 A	15-05-2003 12-07-2001 11-11-1998 30-06-2000 23-05-2000 02-04-2003 12-06-2003 02-06-2003 31-10-2002 15-06-2000 02-02-2000 28-10-2000 30-10-2001 13-10-1999 29-06-2001 05-06-2000 11-09-2001 22-05-2000 21-10-2001 22-10-1998 11-10-1999
EP 0550113	A 07-07-1993	EP	0550113 A2 EP 0782997 A2 GR 3033916 T3 AT 159256 T AT 192154 T AU 667204 B2 AU 3043592 A BR 9205172 A	07-07-1993 09-07-1997 30-11-2000 15-11-1997 15-05-2000 14-03-1996 01-07-1993 06-07-1993

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No.

PCT/EP 03/02413

Patent document cited in search report	Publication date		Patent family member(s)	Publication date
EP 0550113	A		CA 2086404 A1 CN 1075144 A ,B CN 1141119 A ,B DE 69222746 D1 DE 69222746 T2 DE 69230977 D1 DE 69230977 T2 DK 550113 T3 DK 782997 T3 ES 2108727 T3 ES 2147411 T3 GR 3025920 T3 HK 1010105 A1 HU 63305 A2 IL 104244 A JP 3347170 B2 JP 5271234 A NZ 245581 A PL 297160 A1 PL 171579 B1 PT 782997 T RU 2089552 C1 SG 47563 A1 US 5593996 A ZA 9210043 A	01-07-1993 11-08-1993 29-01-1997 20-11-1997 12-02-1998 31-05-2000 09-11-2000 09-02-1998 07-08-2000 01-01-1998 01-09-2000 30-04-1998 23-06-2000 30-08-1993 13-07-1997 20-11-2002 19-10-1993 26-07-1995 06-09-1993 30-05-1997 29-09-2000 10-09-1997 17-04-1998 14-01-1997 28-07-1993
WO 02088126	A 07-11-2002	DE WO	10121162 A1 02088126 A1	31-10-2002 07-11-2002
WO 02088127	A 07-11-2002	DE WO	10121102 A1 02088127 A2	07-11-2002 07-11-2002

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationaler Aktenzeichen  
PCT/EP 03/02413

A. KLASSEFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES  
IPK 7 C07D487/04 A01N43/00

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprässtoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)  
IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprässtoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der Internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 02 02536 A (BAYER AGROCHEM KK ;GOTO TOSHIO (JP); UENO CHIEKO (JP); NARABU SHIN) 10. Januar 2002 (2002-01-10) Beispiel 274 -----	1-3
Y	EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID CO) 8. April 1998 (1998-04-08) in der Anmeldung erwähnt Anspruch 1 -----	1-12
Y	WO 98 46607 A (AMERICAN CYANAMID CO) 22. Oktober 1998 (1998-10-22) in der Anmeldung erwähnt Anspruch 1 ----- -/-	1-12

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist!

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem Internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem Internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem Internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist!

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"S" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der Internationalen Recherche

Absendedatum des Internationalen Recherchenberichts

7. Juli 2003

02.10.03

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde  
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Grassi, D.

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationaler Aktenzeichen  
PCT/EP 03/02413

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	WO 98 46608 A (AMERICAN CYANAMID CO) 22. Oktober 1998 (1998-10-22) in der Anmeldung erwähnt Anspruch 1 -----	1-12
Y	EP 0 550 113 A (SHELL INT RESEARCH) 7. Juli 1993 (1993-07-07) in der Anmeldung erwähnt Anspruch 1 -----	1-12
P,X	WO 02 088126 A (KRUEGER BERND WIELAND ;MAULER-MACHNIK ASTRID (DE); DUNKEL RALF (DE) 7. November 2002 (2002-11-07) das ganze Dokument -----	1-12
P,X	WO 02 088127 A (KRUEGER BERND-WIELAND ;DUNKEL RALF (DE); EBBERT RONALD (DE); BAYER) 7. November 2002 (2002-11-07) das ganze Dokument -----	1-12
X	KOFMAN ET AL.: RUSS. J. ORG. CHEM., Bd. 29, Nr. 11, 1993, Seiten 1942-1943, XPO09012611 in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument -----	10,11

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**Internationales Aktenzeichen  
**PCT/EP 03/02413****Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)**

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1.  Ansprüche Nr.  
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
  
2.  Ansprüche Nr.  
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
  
3.  Ansprüche Nr.  
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

**Feld II Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)**

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

**siehe Zusatzblatt**

1.  Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
  
2.  Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchengebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
  
3.  Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
  
4.  Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:  
1-10

**Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs**

Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.  
 Die Zahlung zusätzlicher Recherchengebühren erfolgte ohne Widerspruch.

WEITERE ANGABEN

PCT/SA/ 210

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, dass diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:

1. Ansprüche: 1-10

Verbindungen gemäss Anspruch 1, Vorläufer davon, ihre Herstellung und Verwendung.

---

2. Ansprüche: 11(Teil),12(Teil)

Aminotriazole und ihre Herstellung (R6 ist Cyan).

---

3. Ansprüche: 11(Teil),12(Teil)

Aminotriazole und ihre Herstellung (R6 ist Brom).

---

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationale Aktenzeichen

PCT/EP 03/02413

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 0202536	A 10-01-2002	JP	2002080460 A	19-03-2002
		AU	7440101 A	14-01-2002
		BR	0112243 A	24-06-2003
		CA	2414879 A1	10-01-2002
		EP	1301492 A1	16-04-2003
		WO	0202536 A1	10-01-2002
EP 0834513	A 08-04-1998	US	5817663 A	06-10-1998
		AT	221069 T	15-08-2002
		DE	69714171 D1	29-08-2002
		DE	69714171 T2	12-12-2002
		EP	0834513 A2	08-04-1998
		JP	10152489 A	09-06-1998
		US	5965561 A	12-10-1999
WO 9846607	A 22-10-1998	AT	202779 T	15-07-2001
		AU	6576898 A	11-11-1998
		DE	69801048 D1	09-08-2001
		DE	69801048 T2	14-03-2002
		DK	975634 T3	24-09-2001
		EP	0975634 A1	02-02-2000
		ES	2160408 T3	01-11-2001
		GR	3036714 T3	31-12-2001
		PT	975634 T	28-12-2001
		WO	9846607 A1	22-10-1998
		ZA	9803055 A	11-10-1999
WO 9846608	A 22-10-1998	AT	239727 T	15-05-2003
		AU	735730 B2	12-07-2001
		AU	6867198 A	11-11-1998
		BG	103805 A	30-06-2000
		BR	9808531 A	23-05-2000
		CN	1104433 B	02-04-2003
		DE	69814375 D1	12-06-2003
		DK	975635 T3	02-06-2003
		EA	2906 B1	31-10-2002
		EE	9900486 A	15-06-2000
		EP	0975635 A1	02-02-2000
		HU	0001993 A2	28-10-2000
		JP	2001520650 T	30-10-2001
		NO	994973 A	13-10-1999
		NZ	500143 A	29-06-2001
		PL	336164 A1	05-06-2000
		SK	141499 A3	11-09-2001
		TR	9902552 T2	22-05-2000
		TW	460476 B	21-10-2001
		WO	9846608 A1	22-10-1998
		ZA	9803054 A	11-10-1999
EP 0550113	A 07-07-1993	EP	0550113 A2	07-07-1993
		EP	0782997 A2	09-07-1997
		GR	3033916 T3	30-11-2000
		AT	159256 T	15-11-1997
		AT	192154 T	15-05-2000
		AU	667204 B2	14-03-1996
		AU	3043592 A	01-07-1993
		BR	9205172 A	06-07-1993
		CA	2086404 A1	01-07-1993

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**  
Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationaler Aktenzeichen  
**PCT/EP 03/02413**

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0550113	A	CN 1075144 A ,B CN 1141119 A ,B DE 69222746 D1 DE 69222746 T2 DE 69230977 D1 DE 69230977 T2 DK 550113 T3 DK 782997 T3 ES 2108727 T3 ES 2147411 T3 GR 3025920 T3 HK 1010105 A1 HU 63305 A2 IL 104244 A JP 3347170 B2 JP 5271234 A NZ 245581 A PL 297160 A1 PL 171579 B1 PT 782997 T RU 2089552 C1 SG 47563 A1 US 5593996 A ZA 9210043 A	11-08-1993 29-01-1997 20-11-1997 12-02-1998 31-05-2000 09-11-2000 09-02-1998 07-08-2000 01-01-1998 01-09-2000 30-04-1998 23-06-2000 30-08-1993 13-07-1997 20-11-2002 19-10-1993 26-07-1995 06-09-1993 30-05-1997 29-09-2000 10-09-1997 17-04-1998 14-01-1997 28-07-1993
WO 02088126	A 07-11-2002	DE 10121162 A1 WO 02088126 A1	31-10-2002 07-11-2002
WO 02088127	A 07-11-2002	DE 10121102 A1 WO 02088127 A2	07-11-2002 07-11-2002

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- BLACK BORDERS**
- IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- FADED TEXT OR DRAWING**
- BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- SKEWED/SLANTED IMAGES**
- COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- GRAY SCALE DOCUMENTS**
- LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- OTHER:** \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**